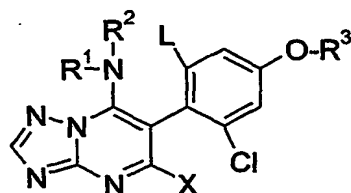


6-(2-Chlor-4-alkoxy-phenyl)-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 L Wasserstoff, Chlor oder Brom;

R¹, R² unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Halogenocycloalkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl
 15 oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden
 20 sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclus oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, (exo)-C₁-C₆-Alkylen und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann;
 25

R³ C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Alkynyl, C₃-C₈-Halogenalkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl, oder Phenyl-C₁-C₄-Alkyl;
 30

R¹, R² und/oder R³ können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen:

R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-
 35 carbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkynyl, C₂-C₆-Halogenalkynyl, C₃-C₆-

Alkinyloxy, C₃-C₆-Halogenalkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkenyloxy, Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

5

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

10

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

15

20

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

25

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können.

30

X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy.

35

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

40

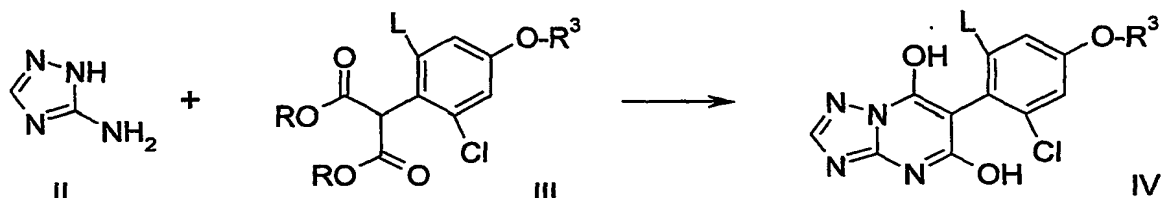
Aus EP-A 71 792, EP-A 550 113 sind 5-Chlor-6-phenyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein bekannt. In WO 99/48893 werden 6-(2-Halogen-4-alkoxy-phenyl)-Triazolopyrimidine allgemein vorgeschlagen. Diese Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den in WO 99/48893 beschriebenen durch die Substitution in den ortho-Positionen des 6-Phenylringes, die im Stand der Technik durch mindestens ein Fluoratom substituiert sind.

Die Wirkung der bekannten Verbindungen ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Demgemäss wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II mit entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel III, in der R für Alkyl, bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht, dargestellt.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C bis 250°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Al-

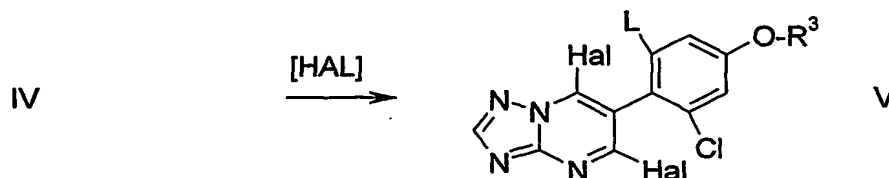
kalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Malonat III in einem Überschuss bezogen auf das Triazol einzusetzen.

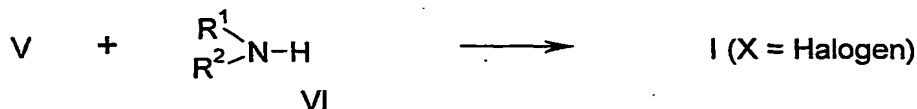
Phenylmalonate der Formel III werden vorteilhaft aus der Reaktion entsprechend substituierter Brombenzole mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse erhalten [vgl. Chemistry Letters, S. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

Die Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel IV werden unter den aus WO-A 94/20501 bekannten Bedingungen in die Dihalogenpyrimidine der Formel V überführt, in der Hal ein Halogenatom, bevorzugt ein Brom oder ein Chloratom, insbesondere ein Chloratom bedeutet. Als Halogenierungsmittel [HAL] wird vorteilhaft ein Chlorierungsmittel oder ein Bromierungsmittel, wie Phosphoroxybromid oder Phosphoroxychlorid, ggf. in Anwesenheit eines Lösungsmittels, eingesetzt.



Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C, durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].

Dihalogenpyrimidine der Formel V werden mit Aminen der Formel VI,



in der R^1 und R^2 wie in Formel I definiert sind, zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, weiter umgesetzt.

5 Diese Umsetzung wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO-A 98/46608].

10 Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Amine, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel VI kann als Base dienen.

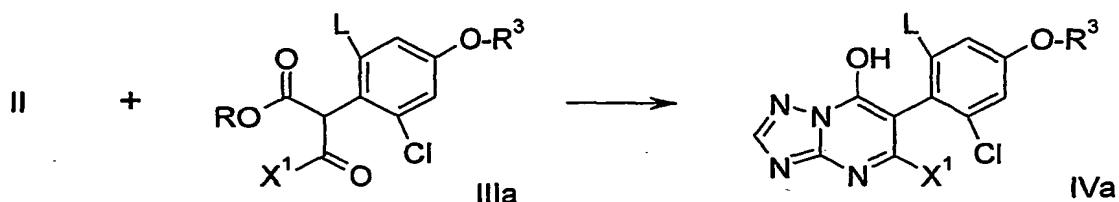
15 Verbindungen der Formel I, in der X Cyano, C_1 - C_6 -Alkoxy oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy bedeutet, können vorteilhaft aus der Umsetzung von Verbindungen I, in der X Halogen, bevorzugt Chlor bedeutet, mit Verbindungen $M-X'$ (Formel VII) erhalten werden. Verbindungen VII stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel VII hat
20 geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

25 Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

30 Verbindungen der Formel I, in denen X für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl steht, können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:

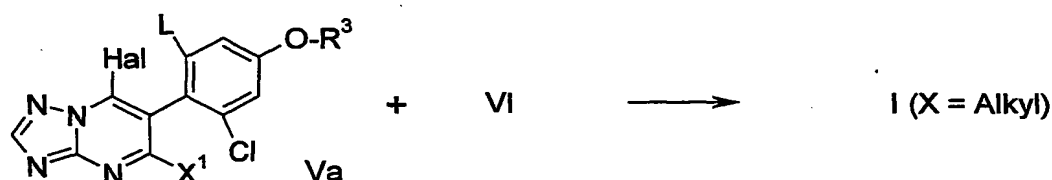


Ausgehend von den Ketoestern IIIa werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine IVa erhalten. In Formeln IIIa und IVa steht X^1 für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halo-

genalkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern (IIIa mit $X^1=CH_3$) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen IIIa erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

5

Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen zu den 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va umgesetzt. Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise von 80 bis 125°C.

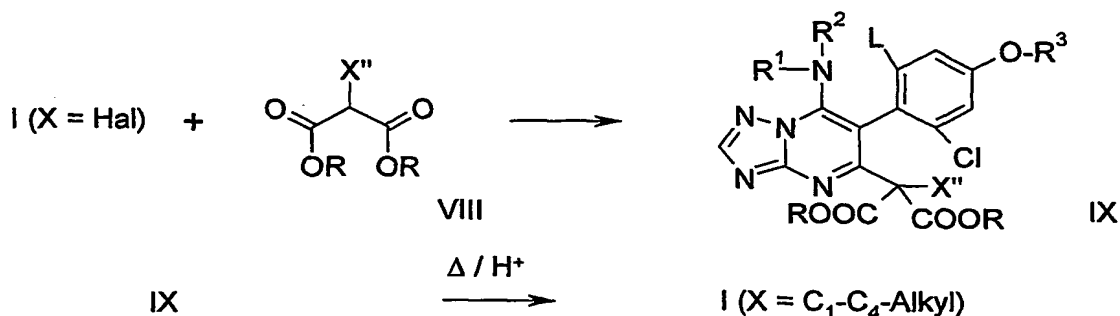


Die Umsetzung von Va mit Aminen VI erfolgt unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen.

15

Verbindungen der Formel I in der X C_1 - C_4 -Alkyl bedeutet, können alternativ auch aus Verbindungen I, in der X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet und Malonaten der Formel VIII hergestellt werden. In Formel VIII bedeuten X'' Wasserstoff oder C_1 - C_3 -Alkyl und R C_1 - C_4 -Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel IX umgesetzt und zu Verbindungen I decarboxyliert [vgl. US 5,994,360].

20



Die Malonate VIII sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

25

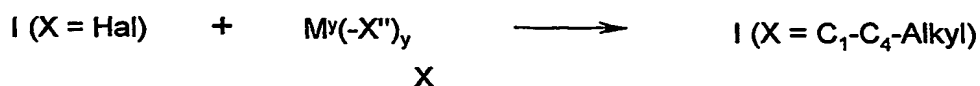
Die anschließende Verseifung des Esters IX erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder

die saure Verseifung der Verbindungen IX vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.

- 5 Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

- 10 Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butyl-
- 15 methylethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl steht, können auch durch Kuppelung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit metallorganischen Reagenzien der Formel X erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



- 25 In Formel X steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn und X'' für C₁-C₃-Alkyl. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd.
- 30 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

- 35 Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die

Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

- 5 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

- 10 Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

- 15 Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

20 Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

- 25 Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

- 30 Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

- 40 Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Positi-

- on, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- 20 Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;
- 25 Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₆-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
- 30 Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C₃-C₈-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;
- 40

fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyc-
lus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

- 5 - 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 4-Isythiazolidinyl, 5-Isythiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 10 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 15 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;
- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, 20 z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 25 - 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;
- 30 Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH₂-Gruppen, z.B. CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;
- Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH₂-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂CH₂, 35 OCH₂CH₂CH₂ und OCH₂CH₂CH₂CH₂;
- Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂O, 40 OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O;

In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Racemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

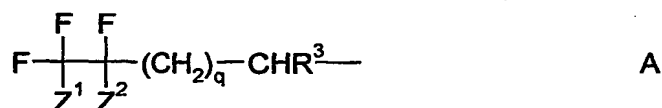
- 5 Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L und R³ der Formel I.

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich
10 allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen der Formel I werden bevorzugt, in denen R¹ nicht Wasserstoff bedeutet.

- Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R¹ für C₁-C₆-Alkyl,
15 C₂-C₆-Alkenyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R¹ für eine Gruppe A steht:



worin

20

Z¹ Wasserstoff, Fluor oder C₁-C₆-Fluoroalkyl,
Z² Wasserstoff oder Fluor, oder
Z¹ und Z² bilden gemeinsam eine Doppelbindung;

q 0 oder 1 ist; und

- 25 R³ Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für C₃-C₆-Cycloalkyl steht, welches durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

- 30 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R² Wasserstoff bedeutet.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R² für Methyl oder Ethyl steht.

- 35 Sofern R¹ und/oder R² Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)- Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R¹ oder R² sind die (R)-konfigurierten Isomere bevorzugt.

- Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidinyl-, Morpholinyl- oder Thiomorpholinylring bilden, insbesondere einen Piperidinylring, der ggf. durch eine bis drei Gruppen Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiert ist. Besonders bevorzugt sind die Verbindungen, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-Methylpiperidinring bilden.

- Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazolring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert ist.

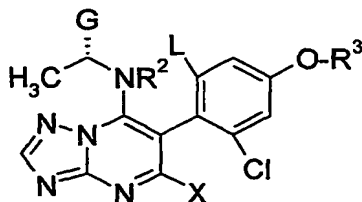
- Daneben sind auch Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen R¹ CH(CH₃)-CH₂CH₃, CH(CH₃)-CH(CH₃)₂, CH(CH₃)-C(CH₃)₃, CH(CH₃)-CF₃, CH₂C(CH₃)=CH₂, CH₂CH=CH₂, Cyclopentyl oder Cyclohexyl; R² Wasserstoff oder Methyl; oder R¹ und R² gemeinsam -(CH₂)₂CH(CH₃)(CH₂)₂-, -(CH₂)₂CH(CF₃)(CH₂)₂- oder -(CH₂)₂O(CH₂)₂- bedeuten.

- Bevorzugt werden Verbindungen I, in denen die Gruppe L Wasserstoff oder Chlor, insbesondere Chlor, bedeutet.

- Daneben werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R³ für C₁-C₄-Alkyl, Halogenmethyl oder Allyl, insbesondere für Methyl, steht.

- Verbindungen I werden bevorzugt, in denen X Halogen, C₁-C₄-Alkyl, Cyano oder C₁-C₄-Alkoxy, wie Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy, besonders Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

- Eine bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.1:



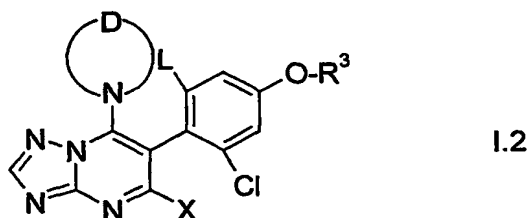
I.1

in der

- G C₂-C₆-Alkyl, insbesondere Ethyl, n- und i-Propyl, n-, sek-, tert- Butyl, und C₁-C₄-Alkoxymethyl, insbesondere Ethoxymethyl, oder C₃-C₆-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopentyl oder Cyclohexyl;
- R² Wasserstoff oder Methyl; und

X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

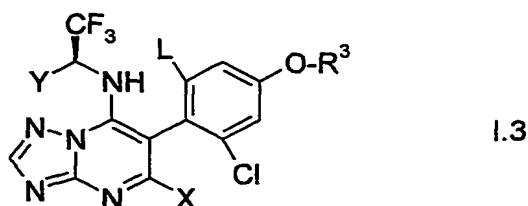
- Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, C₁-C₆-Alkylen und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann. Diese Verbindungen entsprechen insbesondere Formel I.2,



in der

- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₂-Halogenalkyl tragen kann; und
- X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

- Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.3.



in der Y für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, und X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht.

- Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ Methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ Ethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ n-Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 11

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ Benzyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 12

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R³ Allyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 13

Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R³ Methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 14

Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R³ Ethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 15

30 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R³ n-Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 16

35 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R³ tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R³ Fluormethyl bedeuten und die

Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 18

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R^3 Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 19

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R^3 Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 20

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R^3 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 21

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R^3 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 22

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R^3 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 23

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R^3 Benzyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 24

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R^3 Allyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 25

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 Methyl bedeuten und

die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 26

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 Ethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 27

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 n-Butyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 28

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 29

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 30

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 31

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 32

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 33

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 2,2-Difluorethyl be-

deuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 34

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 35

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 Benzyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 36

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff, R^3 Allyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 37

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 Methyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 38

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 Ethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 39

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 n-Butyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 40

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 41

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 Fluormethyl bedeuten und

die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 42

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 43

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 44

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 45

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 46

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 47

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 Benzyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 48

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor, R^3 Allyl bedeuten und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 49

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ Methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 50

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ Ethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 51

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ n-Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 52

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 53

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 54

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 55

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 56

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 57

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 58

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 59

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ Benzyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 60

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R³ Allyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 61

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ Methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 62

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ Ethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 63

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ n-Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 64

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 65

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 66

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 67

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 68

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 69

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 70

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 71

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ Benzyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 72

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R³ Allyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 73

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ Methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle

5 A entspricht

Tabelle 74

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ Ethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

10 entspricht

Tabelle 75

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ n-Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle

15 A entspricht

Tabelle 76

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle

20 A entspricht

Tabelle 77

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

25 belle A entspricht

Tabelle 78

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

30 Tabelle A entspricht

Tabelle 79

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der

35 Tabelle A entspricht

Tabelle 80

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta-

40 belle A entspricht

Tabelle 81

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 82

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 83

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ Benzyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 84

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R³ Allyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 85

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ Methyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 86

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ Ethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 87

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ n-Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 88

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 89

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 90

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 91

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 92

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 93

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 94

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 95

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ Benzyl bedeuten und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 96

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R³ Allyl bedeuten und die

Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 97

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R^3 n-Propyl und X Cyano bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 98

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R^3 n-Propyl und X Cyano bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 99

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R^3 iso-Propyl und X Cyano bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 100

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R^3 iso-Propyl und X Cyano bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 101

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R^3 2-Methoxyethyl und X Cyano bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 102

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R^3 2-Methoxyethyl und X Cyano bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 103

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R^3 n-Propyl und X Methoxy bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 104

Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R³ n-Propyl und X Methoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 105

Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R³ iso-Propyl und X Methoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 106

Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R³ iso-Propyl und X Methoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 107

Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R³ 2-Methoxyethyl und X Methoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 108

Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R³ 2-Methoxyethyl und X Methoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 109

Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R³ Methyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 110

Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R³ Methyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 111

Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R³ Ethyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 112

Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R³ Ethyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 113

Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R³ n-Propyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 114

Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R³ n-Propyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 115

Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R³ iso-Propyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 116

Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R³ iso-Propyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 117

Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R³ 2-Fluorethyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 118

Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R³ 2-Fluorethyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 119

Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R³ Allyl und X Ethoxy bedeutet

und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 120

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R^3 Allyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 121

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen L Wasserstoff, R^3 2-Methoxyethyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 122

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen L Chlor, R^3 2-Methoxyethyl und X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle A

Nr.	R^1	R^2
A-1	H	H
A-2	CH ₃	H
A-3	CH ₃	CH ₃
A-4	CH ₂ CH ₃	H
A-5	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-6	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₂ CF ₃	H
A-8	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-9	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-10	CH ₂ CCl ₃	H
A-11	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-12	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-15	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-16	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-17	CH(CH ₃) ₂	H
A-18	CH(CH ₃) ₂	CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-19	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-20	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-21	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-22	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-24	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-25	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-26	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-27	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-28	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-29	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-30	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-31	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-33	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-34	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-35	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-36	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-37	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-38	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-39	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-40	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-42	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-43	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-44	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-45	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-46	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-47	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-48	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-49	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-51	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-52	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-53	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-54	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-55	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H

Nr.	R ¹	R ²
A-56	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-57	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-60	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-61	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-62	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-63	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-64	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-65	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-66	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-67	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-69	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-71	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-72	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-73	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-74	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-75	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-77	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-78	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-79	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-80	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-81	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-82	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-83	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-84	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-85	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	H
A-86	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-87	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-88	CH ₂ -C≡CH	H
A-89	CH ₂ -C≡CH	CH ₃
A-90	CH ₂ -C≡CH	CH ₂ CH ₃
A-91	Cyclopentyl	H
A-92	Cyclopentyl	CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-93	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-94	Cyclohexyl	H
A-95	Cyclohexyl	CH ₃
A-96	Cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-97	CH ₂ -C ₆ H ₅	H
A-98	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃
A-99	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃
A-100	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-101	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-102	-CH(CH ₃)CH ₂ -CH=CHCH ₂ -	
A-103	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-104	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-105	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-106	-CH ₂ CHF(CH ₂) ₃ -	
A-107	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-108	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-109	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-110	-(CH ₂) ₅ -	
A-111	-(CH ₂) ₄ -	
A-112	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-113	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-114	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-115	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	
A-116	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-117	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -	
A-118	-(CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-119	-CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-120	-(CH ₂) ₂ -CHOH-(CH ₂) ₂ -	
A-121	-(CH ₂) ₆ -	
A-122	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -	
A-123	-(CH ₂) ₂ -N(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	
A-124	-N=CH-CH=CH-	
A-125	-N=C(CH ₃)-CH=C(CH ₃)-	
A-126	-N=C(CF ₃)-CH=C(CF ₃)-	

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen,

insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

- 5 Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

10

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- 15 • *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- 20 • *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- 25 • *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- 30 • *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-cilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

35

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

- 5 Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis 1000 g/100 kg Saatgut, vorzugsweise 1 bis 200 g/100 kg, insbesondere 5 bis

- 10 100 g/100 kg verwendet.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise

- 15 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem

- 20 Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- 25
- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
 - Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silika-
 - 30 te); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
 - 35

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfita-blaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A Wasserlösliche Konzentrate (SL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem
5 wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

B Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter
10 Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D Emulsionen (EW, EO)

20 40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

25 **E Suspensionen (SC, OD)**

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

30

F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate
35 hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

40 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei

der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

2. Produkte für die Direktapplikation

5

H Stäube (DP)

5 Gew.Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

10

I Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

15

J ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

20

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

25

30

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Sitzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereit werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

35

40

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

5

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt

10

werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

15

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

20

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin,
- 25 Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol,
- 30 Epoconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- Dicarboximide wie Iprodion, Myclobzolin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- 35 Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- 40

- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- 5 • Schwefel
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Bentiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon,
- 10 Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

15

Synthesebeispiele

- Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer
- 20 Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1: Herstellung von 2-Chlor-4-methoxyphenylmalonsäurediethylester

- 25 Eine Suspension von Natriumhydrid (0,51 mol) in 140 ml 1,4-Dioxan wurde bei etwa 60°C während 2 Std. mit Malonsäurediethylester (0,49 mol) versetzt. Nach weiteren 10 min Rühren wurden 0,05 mol CuBr zugesetzt. Nach 15 min wurden 0,25 mol 1-Brom-2-Chlor-4-methoxybenzol in 10 ml Dioxan zugegeben. Die Reaktionsmischung wurde etwa 14 Std. bei 100 °C gehalten, dann bei etwa 15°C langsam mit 35 ml 12N
- 30 Salzsäure versetzt. Der Niederschlag wurde abfiltriert, das Filtrat mit Diethylether extrahiert. Nach Phasentrennung wurde die organische Phase getrocknet, dann vom Lösungsmittel befreit. Es blieben 34 g der Titelverbindung zurück.

Beispiel 2: Herstellung von

- 35 5,7-Dihydroxy-6-(2-chlor-4-methoxyphenylphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

- Eine Mischung von 14 g 3-Amino-1,2,4-triazol, 0,17 mol des Esters aus Beispiel 1 und 50 ml Tributylamin (50 ml) wurde etwa sechs Std. bei 180°C gerührt. Bei etwa 70°C wurde eine Lösung von 21 g NaOH in 200 ml Wasser zugegeben und die Mischung
- 40 weiter 30 min gerührt. Die organische Phase wurde abgetrennt und die wässrige Pha-

se mit Diethylether extrahiert. Aus der wässrigen Phase fiel nach Ansäuern mit konz. Salzsäure das Produkt aus. Durch Filtration wurden 32 g der Titelverbindung erhalten.

Beispiel 3: Herstellung von

5 5,7-Dichlor-6-(2-chlor-4-methoxyphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

10 Eine Mischung von 30 g des Triazolopyrimidins aus Beispiel 2 und 50 ml POCl_3 wurde für acht Std. refluxiert, dabei destillierte etwas POCl_3 ab. Der Rückstand wurde in eine CH_2Cl_2 -Wasser-Mischung gegeben, die organische Phase abgetrennt, gewaschen und getrocknet, dann vom Lösungsmittel befreit. Es wurden 22 g der Titelverbindung vom Fp. 163°C erhalten.

Beispiel 4: Herstellung von 5-Chlor-6-(2-chlor-4-methoxyphenyl)-7-but-2-ylamino-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin [I-3]

15 Eine Lösung von 1,5 mmol des Produkts aus Bsp. 3 in 10 ml Dichlormethan wurde unter Rühren mit einer Lösung von 1,5 mmol 2-Butylamin, 1,5 mmol Triethylamin in 10 ml Dichlormethan versetzt. Die Reaktionsmischung wurde etwa 16 Std. bei 20 bis 25°C gerührt, dann mit verd. Salzsäure gewaschen. Die organische Phase wurde ab-
20 getrennt, getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Nach Chromatographie an Kieselgel wurden 250 mg der Titelverbindung vom Fp. 116°C erhalten.

Tabelle I – Verbindungen der Formel I

Nr.	R ¹	R ²	L	R ³	X	phys. Daten (Fp. [°C])
I-1	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	Cl	166
I-2	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		H	CH ₃	Cl	203
I-3	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	Cl	116
I-4	(R) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	Cl	114
I-5	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃	Cl	139
I-6	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃	Cl	128
I-7	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	H	CH ₃	Cl	166
I-8	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	H	CH ₃	Cl	163
I-9	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	H	CH ₃	Cl	165
I-10	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	H	CH ₃	Cl	144
I-11	CH ₂ CF ₃	H	H	CH ₃	Cl	186
I-12	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		H	CH ₃	Cl	138

Aufgrund der gehinderten Rotation der Phenylgruppe können zwei Diastereomeren existieren, die sich in ihren physikalischen Eigenschaften unterscheiden können.

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

5

Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

10

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Dürffleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani*

15 Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Goldene Prinzessin" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^6$ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich
20 die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-1, I-3, I-10 bzw. I-12 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 %
25 befallen waren.

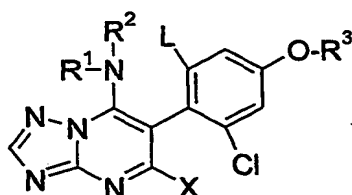
Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea*

30 Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die $1,7 \times 10^6$ Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die
35 Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindung I-12 behandelten Pflanzen keinen
40 Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

L Wasserstoff, Chlor oder Brom;

10 R^1 , R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Halogenalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Halogencycloalkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_2 - C_8 -Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15 R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclus oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_3 - C_6 -Alkenyloxy, C_3 - C_6 -Halogenalkenyloxy, (exo)- C_1 - C_6 -Alkylen und Oxy- C_1 - C_3 -alkylenoxy tragen kann;

25 R^3 C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_8 -Halogenalkenyl, C_3 - C_8 -Alkynyl, C_3 - C_8 -Halogenalkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl, oder Phenyl- C_1 - C_4 -Alkyl;

30 R^1 , R^2 und/oder R^3 können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen:

35 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxy carbonyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Halogenalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_3 - C_6 -Halogenalkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_2 - C_6 -Halogenalkynyl, C_3 - C_6 -Alkynyloxy, C_3 - C_6 -Halogenalkynyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_3 - C_6 -Cycloalkenyloxy, Oxy- C_1 - C_3 -alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedri-

ger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

5 wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

10 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

20 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können.

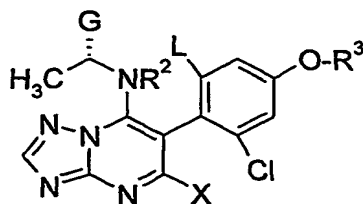
30 X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy.

30

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Chlor bedeutet.
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der R¹ nicht Wasserstoff bedeutet.

35

4. Verbindungen der Formel I.1:



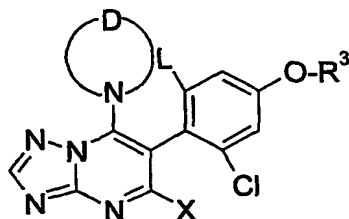
I.1

in der

- G C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxymethyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl;
 R² Wasserstoff oder Methyl; und
 X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten
 und L und R³ gemäß Anspruch 1 definiert sind.

5

5. Verbindungen der Formel I.2:



I.2

in der

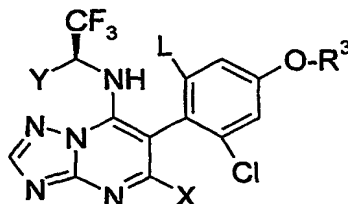
10

- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₂-Halogenalkyl tragen kann;

15

- X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.
 und L und R³ gemäß Anspruch 1 definiert sind.

6. Verbindungen der Formel I.3:



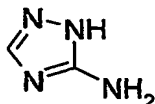
I.3

20

- in der Y für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
 X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht und L und R³ gemäß Anspruch 1 definiert sind.

25

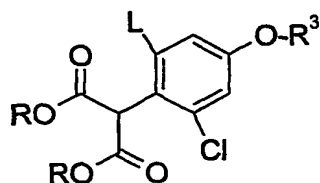
7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II



II

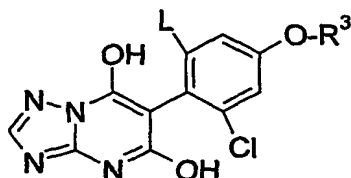
mit Phenymalonaten der Formel III

46



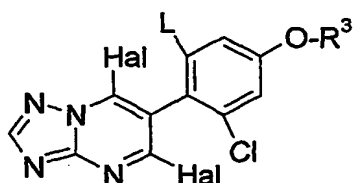
III

in der R für Alkyl steht, zu Dihydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV,



IV

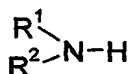
Halogenierung zu den Dihalogenverbindungen der Formel V,



V

5

und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI



VI

zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, gewünschtenfalls zu Herstellung von Verbindungen I, in denen X für Cyano, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, Umsetzung von Verbindungen I, in denen X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel VII,

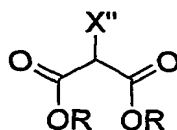
10

M-X'

VII

die je nach der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxy-lat oder ein Halogenalkoxylat darstellen und in der M für ein Ammonium-, Tetra-alkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und gewünschtenfalls, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Alkyl steht, durch Umsetzung der Verbindungen I, in denen X für Halogen steht, mit Malonaten der Formel VIII,

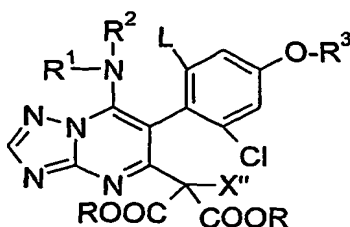
15



VIII

20

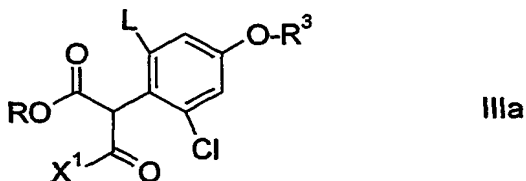
in der X'' Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl und R C₁-C₄-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel IX



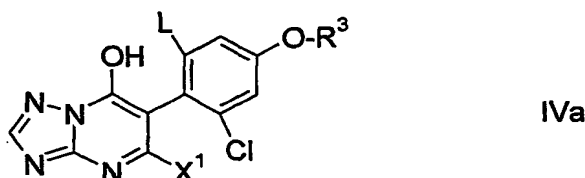
IX

und Decarboxylierung zu Verbindungen I, in denen X für Alkyl steht.

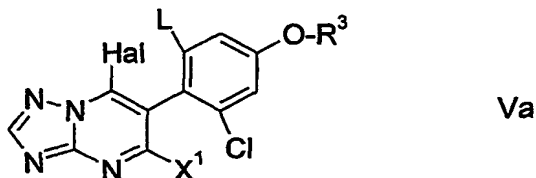
8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II gemäß Anspruch 7 mit Ketoestern der Formel IIIa,



in der X¹ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl und R für C₁-C₄-Alkyl steht, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazaolopyrimidinen der Formel IVa



- 10 Halogenierung von IVa zu 7-Halogenotriazaolopyrimidinen der Formel Va



und Umsetzung von Va mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 7 zu Verbindungen I.

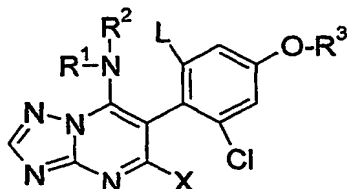
- 15 9. Verbindungen der Formeln IV, IVa, V und Va gemäß Ansprüchen 7 und 8.
10. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1
- 20 11. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 pro 100 kg.
- 25 12. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

6-(2-Chlor-4-alkoxy-phenyl)-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Zusammenfassung

5

Substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 L Wasserstoff, Chlor oder Brom;

R¹, R² Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenycycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Halogenycycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

20 R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclus oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder gemäß der Beschreibung substituiert sein;

R³ Alkyl, Halogenalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl, Cycloalkyl, Halogenycycloalkyl, oder Phenylalkyl;

25 R¹, R² und/oder R³ können gemäß der Beschreibung substituiert sein;

X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy;

30 Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

 International Application No
 PCT/EP2004/014274

 A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

 Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
 IPC 7 C07D A61N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 03/091254 A (BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; GEBAUER, OLAF; GREUL, NICO, JOER) 6 November 2003 (2003-11-06) Zusammenfassung; Seiten 13-17 und 30; Ansprüche; Beispiele, insbesondere Nr. 4 und Nr. 19.	1-7,9-12
X	WO 99/48893 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 30 September 1999 (1999-09-30) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele, insbesondere Nr. 44.	1-7,9-12
X	WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16 May 2002 (2002-05-16) Zusammenfassung; Ansprüche; Seiten 21-22, Beispiele.	1-7,9-12
	----- -/-	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *Z* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

31 March 2005

Date of mailing of the international search report

13/04/2005

Name and mailing address of the ISA

 European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Weisbrod, T

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/014274

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 6 204 269 B1 (PFRENGLE WALDEMAR ET AL) 20 March 2001 (2001-03-20) Zusammenfassung; Ansprüche; Spalten 11-12, Beispiele.	1-7,9-12
Y	WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24 October 2002 (2002-10-24) Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.	1-7,9-12
Y	WO 03/008417 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 30 January 2003 (2003-01-30) Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.	1-7,9-12

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014274

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03091254	A	06-11-2003	DE 10218592 A1	06-11-2003
			AU 2003229657 A1	10-11-2003
			BR 0309568 A	15-02-2005
			WO 03091254 A1	06-11-2003
			EP 1501832 A1	02-02-2005
WO 9948893	A	30-09-1999	US 5981534 A	09-11-1999
			AT 239727 T	15-05-2003
			AT 228133 T	15-12-2002
			AU 752669 B2	26-09-2002
			AU 3098599 A	18-10-1999
			AU 735730 B2	12-07-2001
			AU 6867198 A	11-11-1998
			BG 64197 B1	30-04-2004
			BG 103805 A	30-06-2000
			BR 9808531 A	23-05-2000
			BR 9909009 A	28-11-2000
			CA 2287470 A1	22-10-1998
			CA 2324154 A1	30-09-1999
			CN 1302299 A ,C	04-07-2001
			CZ 20003472 A3	16-01-2002
			CZ 292092 B6	16-07-2003
			DE 69814375 D1	12-06-2003
			DE 69814375 T2	24-12-2003
			DE 69903988 D1	02-01-2003
			DE 69903988 T2	27-03-2003
			DK 975635 T3	02-06-2003
			DK 945453 T3	16-12-2002
			EA 2906 B1	31-10-2002
			EA 3281 B1	24-04-2003
			EE 9900486 A	15-06-2000
			EP 0975635 A1	02-02-2000
			EP 0945453 A1	29-09-1999
			EP 1066291 A1	10-01-2001
			ES 2188094 T3	16-06-2003
			HU 0001993 A2	28-10-2000
			HU 0101751 A2	28-10-2001
			IL 132238 A	29-05-2003
			JP 11322750 A	24-11-1999
			JP 2001520650 T	30-10-2001
			JP 2003522100 T	22-07-2003
			NO 994973 A	13-10-1999
			NZ 500143 A	29-06-2001
			PL 343176 A1	30-07-2001
			PT 945453 T	31-03-2003
			SI 975635 T1	31-10-2003
			SK 141499 A3	11-09-2001
			WO 9948893 A1	30-09-1999
			US 6284762 B1	04-09-2001
			ZA 200005867 A	22-10-2001
			NZ 506912 A	28-03-2003
WO 0238565	A	16-05-2002	AU 2183102 A	21-05-2002
			WO 0238565 A2	16-05-2002
			EP 1368351 A2	10-12-2003
			JP 2004513170 T	30-04-2004
			US 2004110771 A1	10-06-2004

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014274

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 6204269	B1	20-03-2001	US 5986135 A 16-11-1999
			AT 274516 T 15-09-2004
			BR 9904354 A 12-09-2000
			CN 1250052 A 12-04-2000
			DE 69919647 D1 30-09-2004
			EP 1468984 A1 20-10-2004
			EP 0989130 A1 29-03-2000
			JP 2000119275 A 25-04-2000
			KR 2000023437 A 25-04-2000
			SI 989130 T1 31-12-2004
			ZA 9905673 A 30-03-2000
WO 02083677	A	24-10-2002	AT 274518 T 15-09-2004
			DE 60201089 D1 30-09-2004
			DE 60201089 T2 30-12-2004
			WO 02083677 A1 24-10-2002
			EP 1381610 A1 21-01-2004
			JP 2004526767 T 02-09-2004
			US 2004110751 A1 10-06-2004
WO 03008417	A	30-01-2003	BR 0211180 A 10-08-2004
			CA 2453639 A1 30-01-2003
			WO 03008417 A1 30-01-2003
			EP 1412359 A1 28-04-2004
			HU 0401746 A2 28-12-2004
			JP 2005504744 T 17-02-2005
			MX PA04000371 A 04-05-2004
			US 2004162286 A1 19-08-2004

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/014274

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D A61N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 03/091254 A (BAYER CROPSOENCE AKTIENGESELLSCHAFT; GEBAUER, OLAF; GREUL, NICO, JOER) 6. November 2003 (2003-11-06) Zusammenfassung; Seiten 13-17 und 30; Ansprüche; Beispiele, insbesondere Nr. 4 und Nr. 19.	1-7, 9-12
X	WO 99/48893 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 30. September 1999 (1999-09-30) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele, insbesondere Nr. 44.	1-7, 9-12
X	WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16. Mai 2002 (2002-05-16) Zusammenfassung; Ansprüche; Seiten 21-22, Beispiele.	1-7, 9-12
	----- -/-	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

G Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

31. März 2005

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

13/04/2005

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Weisbrod, T

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 6 204 269 B1 (PFRENGLE WALDEMAR ET AL) 20. März 2001 (2001-03-20) Zusammenfassung; Ansprüche; Spalten 11-12, Beispiele.	1-7,9-12
Y	WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24. Oktober 2002 (2002-10-24) Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.	1-7,9-12
Y	WO 03/008417 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 30. Januar 2003 (2003-01-30) Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.	1-7,9-12

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internat. des Aktenzeichen

PCT/EP2004/014274

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03091254 A	06-11-2003	DE 10218592 A1	06-11-2003
		AU 2003229657 A1	10-11-2003
		BR 0309568 A	15-02-2005
		WO 03091254 A1	06-11-2003
		EP 1501832 A1	02-02-2005
WO 9948893 A	30-09-1999	US 5981534 A	09-11-1999
		AT 239727 T	15-05-2003
		AT 228133 T	15-12-2002
		AU 752669 B2	26-09-2002
		AU 3098599 A	18-10-1999
		AU 735730 B2	12-07-2001
		AU 6867198 A	11-11-1998
		BG 64197 B1	30-04-2004
		BG 103805 A	30-06-2000
		BR 9808531 A	23-05-2000
		BR 9909009 A	28-11-2000
		CA 2287470 A1	22-10-1998
		CA 2324154 A1	30-09-1999
		CN 1302299 A ,C	04-07-2001
		CZ 20003472 A3	16-01-2002
		CZ 292092 B6	16-07-2003
		DE 69814375 D1	12-06-2003
		DE 69814375 T2	24-12-2003
		DE 69903988 D1	02-01-2003
		DE 69903988 T2	27-03-2003
		DK 975635 T3	02-06-2003
		DK 945453 T3	16-12-2002
		EA 2906 B1	31-10-2002
		EA 3281 B1	24-04-2003
		EE 9900486 A	15-06-2000
		EP 0975635 A1	02-02-2000
		EP 0945453 A1	29-09-1999
		EP 1066291 A1	10-01-2001
		ES 2188094 T3	16-06-2003
		HU 0001993 A2	28-10-2000
		HU 0101751 A2	28-10-2001
		IL 132238 A	29-05-2003
		JP 11322750 A	24-11-1999
		JP 2001520650 T	30-10-2001
		JP 2003522100 T	22-07-2003
		NO 994973 A	13-10-1999
		NZ 500143 A	29-06-2001
		PL 343176 A1	30-07-2001
		PT 945453 T	31-03-2003
		SI 975635 T1	31-10-2003
		SK 141499 A3	11-09-2001
		WO 9948893 A1	30-09-1999
		US 6284762 B1	04-09-2001
		ZA 200005867 A	22-10-2001
		NZ 506912 A	28-03-2003
WO 0238565 A	16-05-2002	AU 2183102 A	21-05-2002
		WO 0238565 A2	16-05-2002
		EP 1368351 A2	10-12-2003
		JP 2004513170 T	30-04-2004
		US 2004110771 A1	10-06-2004

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014274

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 6204269	B1	20-03-2001	US 5986135 A 16-11-1999
		AT 274516 T 15-09-2004	
		BR 9904354 A 12-09-2000	
		CN 1250052 A 12-04-2000	
		DE 69919647 D1 30-09-2004	
		EP 1468984 A1 20-10-2004	
		EP 0989130 A1 29-03-2000	
		JP 2000119275 A 25-04-2000	
		KR 2000023437 A 25-04-2000	
		SI 989130 T1 31-12-2004	
		ZA 9905673 A 30-03-2000	
WO 02083677	A	24-10-2002	AT 274518 T 15-09-2004
		DE 60201089 D1 30-09-2004	
		DE 60201089 T2 30-12-2004	
		WO 02083677 A1 24-10-2002	
		EP 1381610 A1 21-01-2004	
		JP 2004526767 T 02-09-2004	
		US 2004110751 A1 10-06-2004	
WO 03008417	A	30-01-2003	BR 0211180 A 10-08-2004
		CA 2453639 A1 30-01-2003	
		WO 03008417 A1 30-01-2003	
		EP 1412359 A1 28-04-2004	
		HU 0401746 A2 28-12-2004	
		JP 2005504744 T 17-02-2005	
		MX PA04000371 A 04-05-2004	
		US 2004162286 A1 19-08-2004	